

$R^1=H, R^2=H, R^3=H; R^1=H, R^2=F, R^3=H; R^1=F, R^2=H, R^3=H; R^1=OCH_3, R^2=H, R^3=NO_2; R^1=CH_3, R^2=H, R^3=NO_2.$

Реакцию проводили в среде дихлорметана в присутствии дициклогексилкарбодиимида (DCC) и каталитических количеств 4-диметиламинопиридина (DMAP).

Чистота полученных соединений доказана методом ВЭЖХ, структура подтверждена методами ИК- и ЯМР  $^1H$  спектроскопии, хромато-масс-спектрометрии.

Показано, что по отношению к тест-штаммам микроорганизмов полученные соединения проявляют умеренную антибактериальную активность.

1. Машковский М.Д. Лекарственные средства. М., 2010. 1216 с.

2. Патент РФ 2414221.

*Работа выполнена при финансовой поддержке министерства образования и науки РФ.*

## СИНТЕЗ СПИРОСОЧЛЕНЕННЫХ ТРИАЗОЛОТИАДИАЗИНОВ

*Быстрых О.А., Калинина Т.А., Глухарева Т.В., Моржерин Ю.Ю.*

Уральский федеральный университет

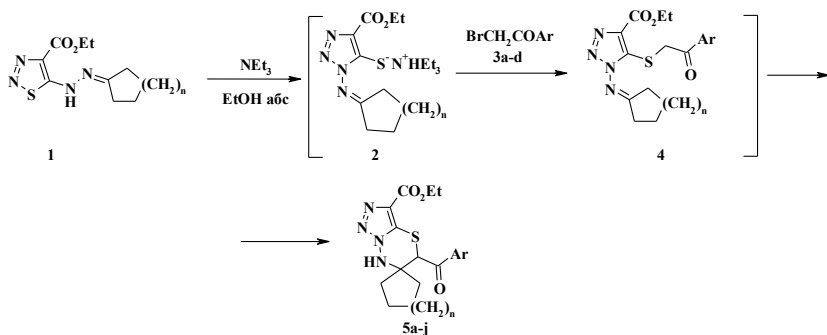
620002, г. Екатеринбург, ул. Мира, д. 19

Одна из причин устойчивого интереса к исследованию полиазот- и серусодержащих гетероциклов - наличие в их ряду значительного количества биологически активных соединений. 1,2,3-Триазольный цикл входит в состав соединений, которые проявляют противоопухолевую, антитромбическую, антимикробную, рострегулирующую, инсектицидную, фунгицидную активность, ингибируют ВИЧ-1 и ВИЧ-2.

1,2,3-Триазоло[5,1-b][1,3,4]тиадиазины получают из малодоступных 1-амино-1,2,3-триазол-5-тиолов. Наши исследования проводились с целью разработки новых методов синтеза производных 1,2,3-триазоло[5,1-b][1,3,4]тиадиазина. В качестве исходного реагента был

выбран этиловый эфир 5-гидразино-1,2,3-тиадиазоло-4-карбоновой кислоты.

Для синтеза спиросочлененных триазолотиадиазинов были получены не описанные ранее тиадиазолилгидразоны циклических кетонов, таких как цикlopентанон, циклогексанон, циклогептанон, по описанной ранее методике [1]. Использование их в качестве исходных соединений позволило синтезировать спиро-6,7-дигидро-5Н-[1,2,3]триазоло[5,1-б][1,3,4]тиадиазины **5a-j**.



3 a R = H; b R = Me; c R = OMe; d R = OEt;

5 a n = 1, Ar = -C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>; b n = 1, Ar = 4-MeC<sub>6</sub>H<sub>4</sub>; c n = 1, Ar = 4-OMeC<sub>6</sub>H<sub>4</sub>; d n = 1, Ar = 4-OEtC<sub>6</sub>H<sub>4</sub>; e n = 2, Ar = -C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>;

f n = 2, Ar = 4-MeC<sub>6</sub>H<sub>4</sub>; g n = 2, Ar = 4-OMeC<sub>6</sub>H<sub>4</sub>; h n = 2, Ar = 4-OEtC<sub>6</sub>H<sub>4</sub>; i n = 3, Ar = -C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>; j n = 3, Ar = 4-MeC<sub>6</sub>H<sub>4</sub>

Синтез спиро-6,7-дигидро-5Н-[1,2,3]триазоло [5,1-б][1,3,4]тиадиазинов **5a-j** включает четыре химические стадии: перегруппировку Димрота тиадиазолилгидразонов циклических кетонов в основной среде, алкилирование образующихся солей **2** α-бромацетофенонами, перенос протона и циклизацию соединений **4**. Выход реакции составляет 80-90%.

Таким образом, нами предложен эффективный метод синтеза спиросочлененных триазолотиадиазинов, которые предположительно обладают биологическим действием.

1. L'abbe G., Vanderstede E. Dimroth rearrangement of 5-hydrazino-1,2,3-thiadiazoles // J. Heteracycl. Chem. 1989. V. 26. P. 1811–1814.

*Исследование проведено при финансовой поддержке молодых ученых УрФУ в рамках реализации программы развития УрФУ и Российского фонда фундаментальных исследований (грант 13-03-00137).*